10 530,513

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号

特開平8-176112

(43)公開日 平成8年(1996)7月9日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	FΙ		技術表示箇所
C 0 7 D 213/78					
A01N 43/08	В				
43/26					
43/32					
43/54	Α				
		審査請求	未請求 請求功	項の数2 OL (全 21 頁)	最終質に続く
(21)出顧番号	特顧平6-3204 11		(71)出顧人	000003126	
				三井東圧化学株式会社	
(22)出顧日	平成6年(1994)12月	122日		東京都千代田区霞が関三丁	目2番5号
			(72)発明者	富谷 完治	
			ļ	千葉県茂原市東郷1144番地	三井東圧化学
				株式会社内	
			(72)発明者	吉川 幸宏	
				千葉県茂原市東郷1144番地	三井東圧化学
				株式会社内	
			(72)発明者	川島秀雄	
				千葉県茂原市東郷1144番地	三井東圧化学
				株式会社内	
					最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 N, N-ジ置換アニリン誘導体およびこれを有効成分とする農園芸用殺菌剤

(57)【要約】

【構成】 一般式 (1)

R₁-N-(1)

R₂ O R₃ (1)

(式中、R¹ は種々のアシル基、カルバモイル基、アルコキシアルキル基等を表し、R² は置換基を有するフェニル基、種々のヘテロ環を表し、R³ はフェニル基、種々のヘテロ環、アルケニル基等を表す。)で表されるN,N-ジ置換アニリン誘導体およびこれを有効成分とする農園芸用殺菌剤。

【効果】 一般式(1)で表されるN, N-ジ置換アニリン誘導体は、幅広い殺菌スペクトラムを有し、特に灰色カビ病菌等に対し、極めて優れた効果を有する。

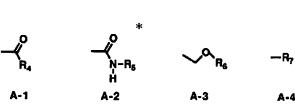
【特許請求の範囲】 【請求項1】 一般式(1)(化1)

【化1】

$$\begin{array}{c}
R_1 - N - \\
R_2 O R_3
\end{array}$$

* [式中、R¹ は以下の化学式(化2)で表されるA-1 ないしA-4のいずれかの基を意味し、 【化2】

2

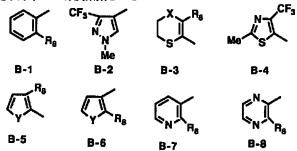


(1)

(式中、R4 は炭素数1~8個のアルキル基、炭素数1~8個のハロアルキル基、フェノキシメチル基を、R5 は炭素数1~8個のアルキル基あるいはフェニル基を表し、R6 は炭素数1~8個のアルキル基、炭素数1~8個のアルコキシアルキル基を表し、R7 は炭素数1~8%

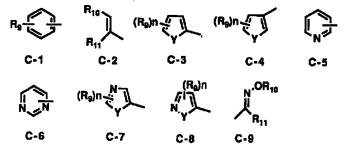
※個のアルキル基を表す。) R² は以下の化学式(化3) で表されるB-1ないしB-8のいずれかの基を意味 し、

【化3】



(式中、R⁸ はハロゲン原子、炭素数1~8個のアルキ ル基あるいは炭素数1~8個のハロアルキル基を、Xは メチレン基あるいは酸素原子を、Yは酸素原子あるいは★30

★硫黄原子を表す)R³ は以下の化学式(化4)で表されるC-1ないしC-9のいずれかの基を意味する。
0 【化4】



(式中、R⁹ は水素原子、炭素数1~8個のアルキル基、炭素数1~8個のハロアルキル基を、R¹⁰、R¹¹は水素原子、または炭素数1~8個のアルキル基を、Yは酸素原子あるいは硫黄原子を表す。また nは1から3の整数で nが2以上の時、R⁹ は同一であっても異なっていてもよい。)]で表されるN,N-ジ置換アニリン誘連体

【請求項2】 請求項1記載のN, N-ジ置換アニリン 誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

【発明の詳細な説明】

[0001]

40☆【産業上の利用分野】本発明はアミド基の窒素原子にアシル基、アルコキシアルキル基もしくはカルバモイル基を導入したカルボン酸アミド誘導体、及び該誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

[0002]

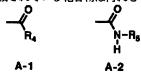
【従来の技術】従来から極めて多岐にわたるカルボン酸アミド類が除草剤、殺菌剤として活性を示すことが広く知られており、中でも安息香酸アミド、あるいはヘテロ環カルボン酸アミドについては、殺菌剤として市販されている薬剤も多い。例えば、安息香酸アミドとして3

☆50 ーイソプロピルオキシー2ーメチルベンズアニリド、あ

るいは α 、 α 、 α -トリフルオロ-3'-イソプロピルオキシー2ートルアニリドはイネ紋枯病、ムギのさび病等に対する殺菌剤として市販されている。また、ヘテロ環カルボン酸アミドとしては5,6ージヒドロー2ーメチルー1,4ーオキサチインー3ーカルボキシアニリドー4,4ージオキシドはキク白さび病、3,4ージヒドロー6ーメチルー2Hーピランー5ーカルボキシアニリドはムギのさび病に対する殺菌剤として市販されている。

【0003】更に、Pestic. Sci., 38, 1~7 (1993)には、チアゾールカルボン酸アミドがコハク酸脱水素酵素の働きを阻害することにより、Rhizoctonia菌に対して活性を有すること、Aust. J. Chem., 36, 135~147 (1983)には、ピラゾールカルボン酸アミドが同様にRhizoctonia菌に対して活性を有することが記載されている。

【0004】一方特開平5-221,994号公報および特開平6-199,803号公報には、アミノ基のo一位にアルキル基、アルコキシ基、アルケニル基、アル 20ケニルオキシ基、アルキニル基、アルキニルオキシ基、シクロアルケニルオキシ基またはフェニル基の置換した種々の芳香族カルボン酸アニリド類が灰色カビ病(Botorytis菌)に効果を有することが記載されている。しかしながらそこに記載されている化合物は何れも*



【0010】(式中、R4 は炭素数1~8個のアルキル基、炭素数1~8個のハロアルキル基、フェノキシメチル基を、R5 は炭素数1~8個のアルキル基あるいはフェニル基を表し、R6 は炭素数1~8個のアルキル基、炭素数1~8個のアルコキシアルキル基を表し、R7 は※

*アミドの窒素原子上に水素原子を有したものであり、そこに具体的に開示された化合物について灰色カビ病に対する殺菌活性を試験したが、防除効果が低く、実用的なものではなかった。

[0005]

【発明が解決しようとする課題】従って、本発明の課題 は優れた病害防除効果を示すと共に、作物に対しても安 全で、なおかつ新規な構造を有する農園芸用殺菌剤を提 供することにある。

0 [0006]

【発明を解決するための手段および作用】本発明者等は 前記課題を解決するため、鋭意検討した結果、N,N-ジ置換アニリン誘導体が灰色カビ病に対し強力な防除効 果を示すことを見出し、本発明を完成した。

【0007】即ち、本発明は、一般式(1)(化5) 【0008】

【化5】

$$R_1-N R_2$$
 O
 R_3
 (1)

[式中、R¹ は以下の化学式(化6)で表されるA−1ないしA−4のいずれかの基を意味し、

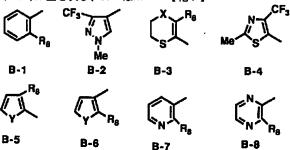
[0009]

【化6】

※炭素数1~8個のアルキル基を表す。) R² は以下の化学式(化7)で表されるB-1ないしB-8のいずれかの基を意味し、

[0011]

【化7】



【0012】(式中、R⁸ はハロゲン原子、炭素数1~8個のアルキル基あるいは炭素数1~8個のハロアルキル基を、Xはメチレン基あるいは酸素原子を、Yは酸素原子あるいは硫黄原子を表す)R³ は以下の化学式(化★

★8) で表されるC-1ないしC-9のいずれかの基を意味する。

[0013]

【化8】

【0014】(式中、R9 は水素原子、炭素数1~8個 のアルキル基、炭素数1~8個のハロアルキル基を、R 10、R11は水素原子、または炭素数1~8個のアルキル 基を、Yは酸素原子あるいは硫黄原子を表す。またnは 1から3の整数でnが2以上の時、R9 は同一であって も異なっていてもよい。)]で表されるN, N-ジ置換 アニリン誘導体及び該誘導体を有効成分として含有する 農園芸用殺菌剤である。

10*【0015】本発明の一般式(1)で表されるアミド誘 導体は新規な化合物であり、下記反応式1ないし4(化 9)で表される方法により、一般式(2)で表されるカ ルボン酸アミドと一般式(3)、(4)、(5)あるい は(6)で表される化合物を塩基存在下に反応させるこ とにより製造できる。

[0016] 【化9】

【0017】(式中、R1 は、反応式1で前記の基A-1を、反応式2で前記の基A-2を、反応式3で前記の 基A-3を、反応式4で前記の基A-4を表し、R4、 R⁵ 、R⁶ 及びR⁷ は前記と同じ意味を表し、Zは塩素 もしくは臭素を表す。)

【0018】本発明に使用できる溶媒としては反応に不 活性であればよく、例えばエーテル、テトラヒドロフラ ン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルス ルホキシド、ジメチルイミダゾリノン等の非プロトン性 極性溶媒、ヘキサン、石油エーテル等の脂肪族炭化水

40%られ、これらの混合溶媒も使用できる。

【0019】本発明反応に用いられる塩基としてはアル カリ金属およびアルカリ土類金属の水素化物、例えば水 素化ナトリウム、水素化カリウム等、アルカリ金属のア ミド、例えばリチウムアミド、ナトリウムアミド等;ア ルカリ金属およびアルカリ土類金属の水酸化物、例えば 水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム 等、アルカリ金属のアミド、例えばリチウムアミド、ナ トリウムアミド等、アルカリ金属およびアルカリ十類金 属の炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭 素、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類等が挙げ※50 酸カルシウム、炭酸マグネシウム等、アルカリ金属およ

びアルカリ土類金属の炭酸水素塩、例えば炭酸水素ナト リウム、炭酸水素カリウム、アルカリ金属アルキル、例 えばメチルリチウム、ブチルリチウム、フェニルリチウ ム、メチルマグネシウムクロライド、アルカリ金属およ びアルカリ土類金属のアルコキシド、例えばナトリウム メトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムーセーブ トキシド、ジメトキシマグネシウム等、種々の有機塩基 類、例えばトリエチルアミン、ピリジン、N、N-ジメ チルアニリン、N-メチルピペリジン、ルチジン、4-ジメチルアミノピリジン等が挙げられ、特に好ましくは 10 【0021】 水素化ナトリウム、ナトリウムアミドである。これらの 塩基の使用量は特に制限されるものではないが、好まし*

*くは一般式(2)で表されるカルボン酸アミドに対して 5モル%から20モル%過剰に使用される。

8

【0020】以上の製造方法により製造できる本発明に 係わる一般式(1)のN、N-ジ置換アニリン誘導体で 農園芸用殺菌剤として好ましく用いられる化合物を以下 の第1表(表1、2)、第2表(表3~8)、第3表 (表9、10)、第4表(表11~16)、第5表(表 17、18)、第6表(表19、20)、第7表(表2 1、22)及び第8表(表23、24)に列挙する。

【表1】

第1表(R²=2-クロロフェニルの場合)

RI	R³
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
Nーエチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-メチルカルバモイル	フェニル
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル
N -フェニルカルバモイル	フェニル
Nーフェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル
メトキシメチル	フェニル

[0022]

※ ※【表2】 第1表(R²=2-クロロフェニルの場合)

R ¹	R³
メトキシメチル	 イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル

[0023]

★ ★【表3】

第2表(R²=3-トリフルオロメチル-1-メチル-4-ピラゾリルの場合

1	_	
- 1		

R1	R³
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
アセチル	2ーチエニル
アセチル	5-メチル-2-チエニル
アセチル	3ーチエニル
アセチル	2 ーフリル
アセチル	2ーピリジル
アセチル	2ーピリミジル
アセチル	5ーチアゾリル
アセチル	5ーイソオキサゾリル
アセチル	1ー (メトキシイミノ) エチル -
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
エタノイル	2ーチエニル
エタノイル	5ーメチルー2ーチエニル
エタノイル	3ーチエニル
エタノイル	2 ーフリル
エタノイル	2ーピリジル
エタノイル	2-ピリミジル
エタノイル	5ーチアゾリル

[0024]

* *【表4】

第2表 (つづき)

Ri	R³
エタノイル	 5−イソオキサゾリル
エタノイル	1- (メトキシイミノ) エチル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
プロパノイル	2ーチエニル
プロパノイル	5ーメチルー2ーチエニル
プロパノイル	3ーチエニル
プロパノイル	2 ーフリル
プロパノイル	2ーピリジル
プロパノイル	2ーピリミジル
プロパノイル	5ーチアゾリル
プロパノイル	5ーイソオキサゾリル
プロパノイル	1 – (メトキシイミノ) エチル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ブタノイル	2ーチエニル
ブタノイル	5 -メチルー2-チエニル
ブタノイル	3ーチエニル
ブタノイル	2 ーフリル
ブタノイル	2ーピリジル
ブタノイル	2-ピリミジル

[0025]

* *【表5】

₽	2	衣	(つ	つ	8)	

R^1	R ³
 ブタノイル	 5ーチアゾリル
ブタノイル	5ーイソオキサゾリル
ブタノイル	1 - (メトキシイミノ) エチル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	2ーチエニル
ペンタノイル	5-メチル-2-チエニル
ペンタノイル	3ーチエニル
ペンタノイル	2 ーフリル
ペンタノイル	2ーピリジル
ペンタノイル	2-ピリミジル
ペンタノイル	5ーチアゾリル
ペンタノイル	5ーイソオキサゾリル
ペンタノイル	1 ー (メトキシイミノ) エチル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	2ーチエニル
ヘキサノイル	5ーメチルー2ーチエニル
ヘキサノイル	3ーチエニル
ヘキサノイル	2-フリル

[0026]

※ ※【表6】

第2表(つづき)

R1	R³
ヘキサノイル	2-ピリジル
ヘキサノイル	2ーピリミジル
ヘキサノイル	5ーチアゾリル
ヘキサノイル	5ーイソオキサゾリル
ヘキサノイル	1 − (メトキシイミノ) エチル
N - エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N -エチルカルバモイル	2ーチエニル
N-エチルカルバモイル	5ーメチルー2ーチエニル
N -エチルカルバモイル	3ーチエニル
N-エチルカルバモイル	2 ーフリル
N-エチルカルバモイル	2-ピリジル
N-エチルカルバモイル	2-ピリミジル
N -エチルカルバモイル	5ーチアゾリル
N-エチルカルバモイル	5ーイソオキサゾリル
N -エチルカルバモイル	1 − (メトキシイミノ) エチル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
Nーフェニルカルバモイル	イソプロペニル

N-フェニルカルバモイル N-フェニルカルバモイル

2-チエニル 5-メチル-2-チエニル

14

[0027]

* *【表7】

第2表(つづき)

R ¹	R³
N-フェニルカルバモイル	3ーチエニル
Nーフェニルカルバモイル	2 ーフリル
N-フェニルカルバモイル	2-ピリジル
N-フェニルカルバモイル	2-ピリミジル
N-フェニルカルバモイル	5ーチアゾリル
N-フェニルカルバモイル	5-イソオキサゾリル
N-フェニルカルバモイル	1 - (メトキシイミノ) エチル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル
フェノキシメチル	2ーチエニル
フェノキシメチル	5ーメチルー2ーチエニル
フェノキシメチル	3ーチエニル
フェノキシメチル	2 ーフリル
フェノキシメチル	2-ピリジル
フェノキシメチル	2-ピリミジル
フェノキシメチル	5ーチアゾリル
フェノキシメチル	5ーイソオキサゾリル
フェノキシメチル	1 - (メトキシイミノ) エチル
メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル

[0028]

※30※【表8】

第2表(つづき)

R^1	R³
メトキシメチル	2ーチエニル
メトキシメチル	5-メチル-2-チエニル
メトキシメチル	3ーチエニル
メトキシメチル	2ーフリル
メトキシメチル	2-ピリジル
メトキシメチル	2ーピリミジル
メトキシメチル	5ーチアゾリル
メトキシメチル	5ーイソオキサゾリル
メトキシメチル	1 - (メトキシイミノ) エチル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	2ーチエニル
メトキシエトキシメチル	5ーメチルー2ーチエニル
メトキシエトキシメチル	3ーチエニル
メトキシエトキシメチル	2ーフリル
メトキシエトキシメチル	2ーピリジル

	(9) 特所			
15 メトキシエトキシメ <i>チ</i> ル	16 2ーピリミジル			
メトキシエトキシメチル	5ーチアゾリル			
メトキシエトキシメチル	5 – イソオキサゾリル			
メトキシエトキシメチル				
	* *【表9】			
第3表(R ² =3-メチルオキサラ	第3表(R ² =3-メチルオキサチイン-2-イルの場合)			
R1	R ³			
アセチル	フェニル			
アセチル	イソプロペニル			
エタノイル	フェニル			
エタノイル	イソプロペニル			
プロパノイル	フェニル			
プロパノイル	イソプロペニル			
ブタノイル	フェニル			
ブタノイル	イソプロペニル			
ペンタノイル	フェニル			
ペンタノイル	イソプロペニル			
ヘキサノイル	フェニル			
ヘキサノイル	イソプロペニル			
N -エチルカルバモイル	フェニル			
N ーエチルカルバモイル	イソプロペニル			
N -メチルカルバモイル	フェニル			
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル			
Nーフェニルカルバモイル				
N-フェニルカルバモイル				
フェノキシメチル	フェニル			
フェノキシメ <i>チ</i> ル 	イソプロペニル 			
第3表 (つづき)	※ ※【表10】			
R ¹	R ³			
メトキシメチル	フェニル			
メトキシメチル	イソプロペニル			
メトキシエトキシメチル	フェニル			
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル			
	★ ★【表11】 ペチルー2-メチルー5-チアゾリルの場			
R ¹	R ³			
アセチル	フェニル			
1 6 1 10				
アセチル	イソプロペニル			

[0034]

[0035]

 \mathbb{R}^3

 R^{1}

_		
	Nーフェニルカルバモイル	5-メチル-2-チエニル
	N -フェニルカルバモイル	3 <i>ーチ</i> エニル
	N – フェニルカルバモイル	2 ーフリル
	N – フェニルカルバモイル	2-ピリジル
	N – フェニルカルバモイル	2-ピリミジル
	N ーフェニルカルバモイル	5ーチアゾリル
	N ーフェニルカルバモイル	5ーイソオキサゾリル
	N-フェニルカルバモイル	1 – (メトキシイミノ) エチル
	フェノキシメチル	フェニル
	フェノキシメチル	イソプロペニル
	フェノキシメチル	2ーチエニル
	フェノキシメチル	5ーメチルー2ーチエニル
	フェノキシメチル	3ーチエニル
	フェノキシメチル	2 ーフリル
	フェノキシメチル	2ーピリジル
	フェノキシメチル	2-ピリミジル
	フェノキシメチル	5ーチアゾリル
	フェノキシメチル	5-イソオキサゾリル
	フェノキシメチル	1 – (メトキシイミノ) エチル
	メトキシメチル	フェニル

[0036]

* *【表16】

第4表 (つづき)

R ¹	R³
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシメチル	2ーチエニル
メトキシメチル	5ーメチルー2ーチエニル
メトキシメチル	3ーチエニル
メトキシメチル	2 ーフリル
メトキシメチル	2ーピリジル
メトキシメチル	2ーピリミジル
メトキシメチル	5ーチアゾリル
メトキシメチル	5ーイソオキサゾリル
メトキシメチル	1 − (メトキシイミノ) エチル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	2ーチエニル
メトキシエトキシメチル	5ーメチルー2ーチエニル
メトキシエトキシメチル	3ーチエニル
メトキシエトキシメチル	2 ーフリル
メトキシエトキシメチル	2ーピリジル
メトキシエトキシメチル	2ーピリミジル
メトキシエトキシメチル	5ーチアゾリル
メトキシエトキシメチル	5ーイソオキサゾリル
メトキシエトキシメチル	1 – (メトキシイミノ) エチル

[0037]

※50※【表17】

23 第5表 (R²=3-メチル-2-チエニルの場合)

R1	R³
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
N ーエチルカルバモイル	フェニル
Nーエチルカルバモイル	イソプロペニル
Nーメチルカルバモイル	フェニル
Nーメチルカルバモイル	イソプロペニル
Nーフェニルカルバモイル	フェニル
N ーフェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル 	イソプロペニル
* * §5表(つづき) 	【表18】
R1	R³
メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	
	イソプロペニル
* *	【表19】
* *	【表19】
※ ※ §6表(R ² =2-メチル-3-フリルの	【表19】 D場合)
※ ※ 6表(R ² =2-メチル-3-フリルの R ¹	【表19】 D場合) R3
※ ※ i6表(R ² =2-メチル-3-フリルの R ¹ アセチル	【表19】 り場合) R ³ フェニル
※ ※ 6表(R ² =2-メチル-3-フリルの R ¹ アセチル アセチル	【表19】 の場合) R ³ フェニル イソプロペニル
※ ※ i6表(R ² =2-メチル-3-フリルの R ¹ アセチル アセチル アセチル エタノイル	【表19】 の場合) R ³ フェニル イソプロペニル フェニル
※ ※ 56表(R ² =2-メチル-3-フリルの R ¹ アセチル アセチル エタノイル エタノイル	【表19】 の場合) R ³ フェニル イソプロペニル フェニル イソプロペニル
※ ※ 56表(R ² =2-メチル-3-フリルの R ¹ アセチル アセチル エタノイル エタノイル プロパノイル	【表19】 D場合) R3 フェニル イソプロペニル フェニル イソプロペニル フェニル フェニル
※ ※ R1 Pセチル アセチル エタノイル エタノイル プロパノイル プロパノイル	【表19】 D場合) R3 フェニル イソプロペニル フェニル イソプロペニル イソプロペニル フェニル
※ ※ F6表(R ² =2-メチル-3-フリルの R ¹ アセチル アセチル エタノイル エタノイル プロパノイル プロパノイル ブタノイル	【表19】 の場合) R ³ フェニル イソプロペニル フェニル イソプロペニル イソプロペニル フェニル フェニル フェニル フェニル

[0038]

[0039]

25 26 ヘキサノイル フェニル ヘキサノイル イソプロペニル N-エチルカルバモイル フェニル N-エチルカルバモイル イソプロペニル Nーメチルカルバモイル フェニル Nーメチルカルバモイル イソプロペニル N-フェニルカルバモイル フェニル Nーフェニルカルバモイル イソプロペニル フェノキシメチル フェニル フェノキシメチル イソプロペニル [0040] * *【表20】 第6表(つづき) \mathbb{R}^1 \mathbb{R}^3 メトキシメチル フェニル イソプロペニル メトキシメチル メトキシエトキシメチル フェニル メトキシエトキシメチル イソプロペニル [0041] ※ ※【表21】 第7表(R²=2-クロロ-3-ピリジルの場合) \mathbb{R}^{1} \mathbb{R}^3 アセチル フェニル アセチル イソプロペニル エタノイル フェニル エタノイル イソプロペニル プロパノイル フェニル プロパノイル イソプロペニル ブタノイル フェニル ブタノイル イソプロペニル ペンタノイル フェニル ペンタノイル イソプロペニル ヘキサノイル フェニル ヘキサノイル イソプロペニル N-エチルカルバモイル フェニル N-エチルカルバモイル イソプロペニル N-メチルカルバモイル フェニル N-メチルカルバモイル イソプロペニル N-フェニルカルバモイル フェニル Nーフェニルカルバモイル イソプロペニル フェノキシメチル フェニル フェノキシメチル イソプロペニル [0042] ★ ★【表22】 第7表(つづき)

28

R1	R ³	
メトキシメチル	フェニル	
メトキシメチル	イソプロペニル	
メトキシエトキシメチル	フェニル	
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル	

【0043】

* *【表23】 第8表(R²=2-クロロ-3-ピラジニルの場合)

R1	R³
アセチル	フェニル
アセチル・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
N -エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-メチルカルバモイル	フェニル
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル
N -フェニルカルバモイル	フェニル
N -フェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル

[0044]

※ 《【表24】

第8表(つづき)

R ¹	R³
メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル

【0045】本発明の一般式(1)で表わされる化合物 は、キュウリ、トマト、イチゴ、ブドウ等の灰色かび病 (Botrytis cinerea)の他、ウリ類のうどんこ病(Sphaero theca fuliginea)、ムギ類のうどんこ病(Erysiphe gram inis f. sp. hordei, f. sp.tritici)、イチゴうどんこ 病(Sphaerotheca humuli)、ブドウうどんこ病(Uncinula necator)、リンゴうどんこ病(Podosphaera leucotrich★50

★a)、リンゴ黒星病(Venturia inaequalis)、ナシ黒星病 (Venturia nashicola)、リンゴ赤星病(Gymnosporangium yamadae)、ナシ黒斑病(Alternaria kikuchiana)、リン ゴ斑点落葉病(Alternaria mali)、ムギ類のさび病(Pucc inia striiformis, P. graminis, P. recondita, P. ho rdei)等に対し優れた防除効果を示す。

【0046】本発明に係わる一般式(1)で表わされる

化合物を農園芸用殺菌剤として使用する場合は、処理す る植物に対して原体をそのまま使用してもよいが、一般 には不活性な液体担体または固体担体と混合し、通常用 いられる製剤形態である粉剤、水和剤、フロワブル剤、 乳剤、粒剤およびその他の一般に慣用される形態の製剤 として使用される。更に製剤上必要ならば補助剤を添加 することもできる。

【0047】ここでいう担体とは、処理すべき部位への 有効成分の到達を助け、また有効成分化合物の貯蔵、輸 送、取扱いを容易にするために配合される合成または天 10 然の無機または有機物質を意味する。担体としては、通 常農園芸用薬剤に使用されるものであるならば固体また は液体のいずれでも使用でき、特定のものに限定される ものではない。

【0048】例えば、固体担体としては、モンモリロナ イト、カオリナイト等の粘土類、珪藻土、白土、タル ク、バーミュキュライト、石膏、炭酸カルシウム、シリ カゲル、硫安等の無機物質、大豆粉、鋸屑、小麦粉等の 植物性有機物質および尿素等があげられる。

【0049】液体担体としては、トルエン、キシレン、 クメン等の芳香族炭化水素類、ケロシン、鉱油などのパ ラフィン系炭化水素類、アセトン、メチルエチルケトン などのケトン類、ジオキサン、ジエチレングリコールジ メチルエーテルなどのエーテル類、メタノール、エタノ ール、プロパノール、エチレングリコールなどのアルコ ール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド および水等があげられる。

【0050】更に本発明化合物の効力を増強するため に、製剤の剤型、適用場面等を考慮して目的に応じてそ れぞれ単独に、または組み合わせて次の様な補助剤を使 30 用することも出来る。補助剤としては、通常農園芸用薬 剤に使用される界面活性剤、結合剤(例えば、リグニン スルホン酸、アルギン酸、ポリビニルアルコール、アラ ピアゴム、CMCナトリウム等)、安定剤(例えば、酸 化防止用にフェノール系化合物、チオール系化合物また は高級脂肪酸エステル等を用いたり、pH調整剤として 燐酸塩を用いたり、時に光安定剤も用いる)等を必要に 応じて単独または組み合わせて使用出来る。更に場合に よっては防菌防黴のために工業用殺菌剤、防菌防黴剤な どを添加することもできる。

【0051】補助剤について更に詳しく述べる。乳化、 分散、拡展、湿潤、結合、安定化等の目的ではリグニン スルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキ ル硫酸エステル塩、ポリオキシアルキレンアルキル硫酸 塩、ポリオキシアルキレンアルキルリン酸エステル塩等 のアニオン性界面活性剤、ポリオキシアルキレンアルキ ルエーテル、ポリオキシアルキレンアルキルアリールエ ーテル、ポリオキシアルキレンアルキルアミン、ポリオ キシアルキレンアルキルアミド、ポリオキシアルキレン

30

ーテル、ポリオキシアルキレン脂肪酸エステル、グリセ リン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリ オキシアルキレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキ シプロピレンポリオキシエチレンブロックポリマー等の 非イオン性界面活性剤、ステアリン酸カルシウム、ワッ クス等の滑剤、イソプロピルヒドロジエンホスフェート 等の安定剤、その他メチルセルロース、カルボキシメチ ルセルロース、カゼイン、アラビアゴム等があげられ る。しかし、これらの成分は以上のものに限定されるも のではない。

【0052】本発明に係わる農園芸用殺菌剤における一 般式(1)で表わされる化合物の含有量は、製剤形態に よっても異なるが、通常粉剤では0.05~20重量 %、水和剤では0.1~80重量%、乳剤では1~50 重量%、フロワブル製剤では1~50重量%、ドライフ ロワブル製剤では1~80重量%であり、好ましくは、 粉剤では0.5~5重量%、水和剤では5~80重量 %、粒剤では0.5~8重量%、乳剤では5~20重量 %、フロワブル製剤では5~30重量%およびドライフ ロワブル製剤では5~50重量%である。

【0053】補助剤の含有量は0~80重量%であり、 担体の含有量は、100重量%から有効成分化合物およ び補助剤の含有量を差し引いた量である。

【0054】本発明組成物の施用方法としては種子消 毒、茎葉散布等があげられるが、通常当業者が利用する どの様な施用方法にても十分な効力を発揮する。施用量 および施用濃度は対象作物、対象病害、病害の発生程 度、化合物の剤型、施用方法および各種環境条件等によ って変動するが、散布する場合には有効成分量としてへ クタール当たり50~1,000gが適当であり、望ま しくはヘクタール当り100~500gである。また水 和剤、フロワブル剤または乳剤を水で希釈して散布する 場合、その希釈倍率は200~20,000倍が適当で あり、望しくは1,000~5,000倍である。

【0055】本発明の農園芸用殺菌剤は他の殺菌剤、殺

虫剤、除草剤および植物成長調節剤等の農薬、土壌改良 剤または肥効物質との混合使用は勿論のこと、これらと の混合製剤も可能である。殺菌剤としては例えば、トリ アジメホン、ヘキサコナゾール、プロクロラズ、トリフ 40 ルミゾール等のアゾール系殺菌剤、メタラキシル、オキ サディキシル等のアシルアラニン系殺菌剤、チオファネ ートメチル、ベノミル等のベンズイミダゾール系殺菌 剤、マンゼブ等のジチオカーバメート系殺菌剤およびテ トラクロロイソフタロニトリル、硫黄等があげられ、殺 虫剤としては例えば、フェニトロチオン、ダイアジノ ン、ピリダフェンチオン、クロルピリホス、マラソン、 フェントエート、ジメトエート、メチルチオメトン、プ ロチオホス、DDVP、アセフェート、サリチオン、E PN等リン系殺虫剤、NAC、MTMC、BPMC、ピ アルキルアミド、ポリオキシアルキレンアルキルチオエ 50 リミカーブ、カルボスルファン、メソミル等のカーバメ

ート系殺虫剤およびエトフェンプロックス、ベルメトリン、フェンバレレート等のピレスロイド系殺虫剤等があげられるが、これに限定されるものではない。

[0056]

【実施例】次に実施例を挙げて本発明化合物の製造法を 具体的に説明する。

実施例1 NーアセチルーNー(2-フェニル)フェニル 4ートリフルオロメチルー2ーメチルチアゾールー5ーカルボン酸アミドの合成

60%水素化ナトリウム0.03gをTHF10m1に 懸濁させ氷冷攪拌下にN-(2-フェニル)フェニル 4-トリフルオロメチルー2-メチルチアゾールー5-カルボン酸アミド0.20g(0.52mmo1)のT HF2m1溶液を滴下した。5分間同温度で攪拌した後 無水酢酸0.07g(0.98mmo1)を滴下した。 徐々に室温まで昇温させながら攪拌し溶媒を水中に注ぎ 込み酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和重曹水で 順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧 下に留去し目的物を結晶として0.16g(収率71.7%)得た。

¹H NMR(CDCl₃, δ値):2.04(3H,s),2.69(3H,s),7.22-7.37 (4H,m),7.40-7.70(5H,m)

*【0057】実施例2 N-(N-エチルカルバモイル)-N-(2-フェニル)フェニル4-トリフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボン酸アミドの合成

32

60%水素化ナトリウム0.03gをTHF10m1に 懸濁させ氷冷撹拌下にN-(2-フェニル)フェニル 4ートリフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボン酸アミド0.25g(0.69mmo1)のT HF2m1溶液を滴下した。5分間同温度で撹拌した後 10 イソシアン酸エチル0.05m1を滴下した。徐々に室 温まで昇温させながら撹拌し溶媒を水中に注ぎ込み酢酸 エチルで抽出した。有機層を水、飽和重曹水で順次洗浄 し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去 し目的物を結晶として0.24g(収率80.0%)得 た。

¹H NMR(CDCl₃, δ値):1.21(3H,t J=7.3Hz),2.57(3H,s), 3.41(2H,m),7.13-7.18(2H,m),7.28-7.50(7H,m),8.46(1 H,bs)

【0058】この様な製造例によって製造される本発明 20 の化合物のいくつかを第9表(表25~27)に示す。 【0059】 【表25】

第9表

化合物	物			
番号	R1	R ²	R³	NMR(CDC13, δ値)
1	Ptfh	4-トリフルオロメテル-2-メテル -5-チアソ゚リル	71=h	2.04(3H,s),2.69(3H,s), 7.22-7.37(4H,m),7.40-7.72 (5H,m)
2	イ ሃ 7 ⁺ チ ህ ル	4-}Y7kta4fk-2-4fk -5-ffy*yk	フェニル	0.73(3H,d J=7.3Hz),1.00(3H,d J=7.3Hz),2.50(1H,sep- tet J=7.3Hz),2.70(3H,s), 7.23-7.57(9H,m)
3	^7° \$/{k	4-トリアルオロメテル-2-メテル -5-チアソ゚リル	71=k	0.83(3H,t J=7.3Hz),1.09- 1.38(8H,m),2.05-2.81(2H,m) 2.68(3H,s),7.22-7.57(9H,m)
4	フェノキシアセチル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアソ・リル	71=k	2.64(3H,s),4.76(1H,d J=4.3 Hz),4.79(1H,d J=4.3Hz) 6.69(2H,m),7.20-7.34(6H,m) 7.42-7.64(6H,m)
5	N-フェニル カルハ' モイル	4-トリフルネロメテル-2-メテル -5-チァソ゚リル	7z=k	2.28(3H,s),6.51(1H,bs) 7.15(2H,m),7.34-7.54(14H,m)

[0060]

※50※【表26】

33 第9表(つづき)

ルムル	la			
化合 [‡] 番号 ——		R ²	R³	NMR (CDCl3, &値)
6	N-エチル カルハ' モイル	4-トリアルネロメテル-2-メテル -5-チアソ゚リル	71=k	1.21(3H,t J=7.3Hz),2.57(3H,s),3.41(2H,m),7.13-7.18(2H,m),7.28-7.50(7H,m),8.46(1H,bs)
7	XFN	4-トリフルオロメテル-2-メテル -5-チアソ゚リル	71=k	2.55(3H,s),3.25(3H,s), 7.18-7.25(2H,m),7.31-7.48 (7H,m)
8	*AP\$YXF#	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアソ・リル	71=N	3.47(3H,s),4.43(1H,d J= 10.1Hz),5.54(1H,d,J= 10.1Hz),7.15-7.19(3H,m), 7.26-7.50(6H,m)
9	メトキシエトキシ メデル	4-トリフルオロメテル-2-メテル -5-チアゾリル	71=k	2.56(3H,s),3.37(3H,s),3.55 3.57(2H,m),3.77-3.95(2H,m) 4.55(1H,d J=10.3Hz),5.65(1H,d J=10.3Hz),7.32-7.44 (9H,m)
第 9 ——— 化合物)表(つづき 		*【表27	71
番号		R²	R³	NMR(CDCl3, &値)
10	7tFh	4-トリフルオロメテル-2-メテル -5-チアソ゚リル	2-メトキシ イミノエチル	
11	Ptfl	3-トリフルオロメテル-1-メテル 4-ピラソ゚リル	71=k	2.08(3H,s),3.92(3H,s), 7.26-7.33(4H,m),7.42-7.70 (5H,m)
12	プ"ロハ" /イル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアソ・リル	フェニル	0.73(3H,t d J=7.3Hz),2.10 2.35(2H,m),2.68(3H,s), 7.19-7.57(9H,m)

【0062】参考例1 N-(2-イソプロピルフェニ ル) -2-メチル-4-トリフルオロメチルチアゾール ー5-カルボン酸アミド (対照化合物A、特開平-22 1,994号公報に記載の化合物)

[0061]

実施例1においてアニリンとして2-イソプロピルアニ リンを、カルボン酸として2-メチルー4-トリフルオ※50 特開平-221,994号公報に記載の化合物)

※ロメチルチアゾールー5-カルボン酸を用いた以外は全 く同様の方法で行った。融点114~115℃の目的化 合物を得た。

【0063】参考例2 N-(2-イソプロピルフェ ニル)-2-クロロニコチン酸アミド (対照化合物B、

実施例1においてアニリンとして2-イソプロピルアニ リンを用いた以外は全く同様の方法で行った。融点12 3~124.5℃の目的化合物を得た。

【0064】製剤例および生理試験例

次に本発明に係わる農園芸用殺菌剤の製剤例および試験 例を示す。

製剤例1 粉剤

化合物番号1の化合物3部、ケイソウ土20部、白土3 O部およびタルク47部を均一に粉砕混合して粉剤10 0部を得た。

【0065】製剤例2 水和剤

化合物番号1の化合物25部、ケイソウ土47部、白土 25部、リグニンスルホン酸ナトリウム1部およびアル キルベンゼンスルホン酸ナトリウム2部を均一に粉砕混 合して水和剤100部を得た。

【0066】製剤例3 水和剤

化合物番号1の化合物50部、タルク40部、ラウリル リン酸ナトリウム5部およびアルキルナフタレンスルホ ン酸サトリウム5部を混合し、水和剤100部を得た。

【0067】製剤例4 水和剤

化合物番号2の化合物50部、リグニンスルホン酸ナト リウム10部、アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウ ム5部、ホワイトカーボン10部およびケイソウ土25 部を混合粉砕し、水和剤100部を得た。

【0068】製剤例5 乳剤

化合物番号2の化合物10部、シクロヘキサン10部、 キシレン60部およびソルボール (東邦化学製界面活性 剤)20部を均一に溶解混合し、乳剤100部を得た。 【0069】製剤例6 フロワブル剤

化合物番号2の化合物40部、カルボキシメチルセルロ 30 【表28】

ース3部、リグニンスルホン酸ナトリウム2部、ジオク チルスルホサクシネートナトリウム塩1部および水54 部をサンドグラインダーで湿式粉砕し、フロワブル剤1 00部を得た。

36

【0070】次に本発明化合物の農園芸用殺菌剤として の効力を試験例によって説明する。なお試験例において は、上記参考例の化合物を対照剤として用いた。

試験例1 インゲン灰色かび病防除効果試験

温室内で直径7.5cmのビニールポットに子葉の展開 10 まで2本づつ生育させたインゲン(品種:つるなしトッ プクロップ)に、製剤例3に準じて調整した水和剤を所 定濃度に希釈して、4ポット当たり50mlづつ散布し た。薬液が風乾した後、PDA培地上で培養した灰色か び病菌から調製した分生胞子懸濁液 (1×105 個/m 1)を子葉上に噴霧接種し、20~23℃、湿度95% 以上の温室に7日間保った。接種7日後、インゲン1葉 当たりに灰色かび病の病斑が占める面積を次の指標に従 って調査し、下記式(数1)により防除価を算出した。 結果を第10表(表28、29)に示す。

20 発病度 0:発病なし

1:病斑の面積が5%以下

2:病斑の面積が5~25%

3:病斑の面積が25~50%

4:病斑の面積が50%以上

各処理区および無処理区の平均値を発病度とした [0071]

【数1】防除価(%)=(1-処理区の発病度/無処理 区の発病度)×100

[0072]

第10表

38

化合物番号	有効成分濃度(ppm)	防除価(%)
本発明化合物	200	100
1	5 0	100
本発明化合物	200	100
4	5 0	3 3
本発明化合物	200	100
7	5 0	6 7
本発明化合物	200	100
8	5 0	100
本発明化合物	200	100
1 0	5 0	3 3
本発明化合物	200	100
11	5 0	100

[0073]

第10表

化合物番号	有効成分濃度(ppm)	防除価(%)
対照化合物	200	9 0
A	5 0	6 5
対照化合物	200	2 7
В	5 0	0

* *【表29】

[0074]

【発明の効果】本発明の一般式(1)で表される化合物を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤は、キュウ ※

※リ、トマト、イチゴ、ブドウ等各種作物の灰色かび病に 対し優れた防除効果を示し、農園芸用殺菌剤として有用 である。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 6		識別記号	庁内整理番号	FI	技術表示箇所
A01N 4	43/56		В		
4	43/60				
4	43/76				
4	43/78		В		
			Α		
4	43/80	101			
		102			
4	43/84	102			
C O 7 D 23	31/14				

241/24	
261/08	
263/32	
275/02	
277/56	
307/68	
333/06	
333/08	
401/12	231
403/12	231
405/12	231
409/12	231
413/12	231
417/12	213
-	231
	239
	261
	307
	333

(72)発明者 松永 浩文

千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学

株式会社内

(72)発明者 勝田 裕之

千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学 株式会社内 (72) 発明者 柳瀬 勇次

千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学

株式会社内

(72)発明者 貴志 淳郎

千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学

株式会社内

(72)発明者 稲見 俊一

千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学

株式会社内

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number:

08-176112

(43) Date of publication of application: 09.07.1996

(51)Int.Cl.

C07D213/78 A01N 43/08 A01N 43/26 A01N 43/32 A01N 43/54 A01N 43/56 A01N 43/60 A01N 43/76 A01N 43/78 A01N 43/80 A01N 43/80 A01N 43/84 C07D231/14 C07D241/24 C07D261/08 C07D263/32 C07D275/02 C07D277/56 C07D307/68 C07D333/06 C07D333/08 C07D401/12 C07D403/12 C07D405/12 C07D409/12 C07D413/12 C07D417/12 C07D417/12 C07D417/12

C07D417/12 C07D417/12 C07D417/12

(21)Application number: 06-320411

(71)Applicant: MITSUI TOATSU CHEM INC

(22) Date of filing:

22.12.1994

(72)Inventor: TOMITANI KANJI

YOSHIKAWA YUKIHIRO KAWASHIMA HIDEO

MATSUNAGA HIROFUMI

KATSUTA HIROYUKI

YANASE YUJI

KISHI JUNRO

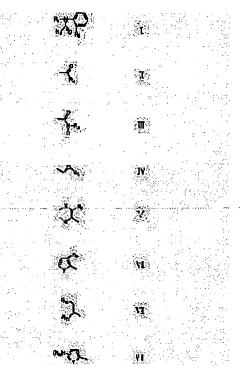
INAMI SHUNICHI

(54) N,N'-DISUBSTITUTED ANILINE DERIVATIVE AND MICROBICIDAL AGENT FOR AGRICULTURE AND HORTICULTURE USING THE DERIVATIVE AS ACTIVE COMPONENT

(57) Abstract:

PURPOSE: To obtain a new N,N'-disubstituted aniline derivative having a broad microbicidal spectrum, especially extremely excellent effect against Botrytis cinerea, etc.

CONSTITUTION: This is a compound of formula I [R1 is one selected from formula II to formula IV (R4 is a 1-8C alkyl, a 1-8C haloalkyl or phenoxymetyl; R5 is a 1-8C alkyl or phenyl; R6 is a 1-8C alkyl or a 1-8C alkoxyalkyl; R7 is a 1-8C alkyl); R2 is an O-R8-substituted phenyl, formula V, formula VI (R8 is a halogen, a 1-8C alkyl or a 1-8C haloalkyl; X is CH2 or O or S), 3- trifluoromethyl-1-methyl-4-pyrazolyl, 4-trifluoromethyl-2-methyl-5-thiazolyl, etc.; R3 is a phenyl substituted with R9, formula VII, formula VIII (R9 is H, a 1-8C alkyl, a 1-8C haloalkyl; R10



and R11 are each H, a 1-8C alkyl; n=1-3), etc.], e.g. N-acetyl-N-(2-phenyl)phenyl 4-triluoromethyl-2-methylthiazole-5-carbonamide.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

* NOTICES *

JPO and NCIPI are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

- 1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
- 2.**** shows the word which can not be translated.
- 3.In the drawings, any words are not translated.

CLAIMS

[Claim(s)]

[Claim 1] General formula (1) (** 1)

[Formula 1]

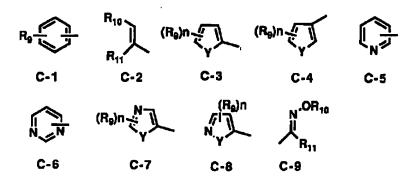
$$\begin{array}{c|c}
R_1 - N - \\
R_2 & O \\
R_3
\end{array}$$
(1)

The inside of [type and R1 mean the radical of either A-1 expressed with the following chemical formulas (** 2) thru/or A-4, and are [Formula 2].

the inside of a formula, and R4 -- the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the halo alkyl group of 1-8 carbon numbers -- a phenoxymethyl radical -- R5 the alkyl group of 1-8 carbon numbers, or a phenyl group -- expressing -- R6 the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the alkoxyalkyl group of 1-8 carbon numbers -- expressing -- R7 The alkyl group of 1-8 carbon numbers is expressed. R2 The radical of either B-1 expressed with the following chemical formulas (** 3) thru/or B-8 is meant, and it is [Formula 3].

(Among a formula, in R8, X expresses a methylene group or an oxygen atom, and Y expresses an oxygen atom or a sulfur atom for a halogen atom, the alkyl group of 1-8 carbon numbers, or the halo alkyl group of 1-8 carbon numbers) R3 The radical of either C-1 expressed with the following chemical formulas (** 4) thru/or C-9 is meant.

[Formula 4]



(Among a formula, in R9, R10 and R11 express a hydrogen atom or the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and Y expresses an oxygen atom or a sulfur atom for a hydrogen atom, the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the halo alkyl group of 1-8 carbon numbers.) Moreover, n is R9 when n is two or more for the integer of 1 to 3. Even if the same, you may differ. N [which is expressed with]], and N-JI permutation aniline derivative.

-[Claim 2] The germicide for plantation arts which contains according to claim 1 N and N-JI permutation aniline derivative as an active principle.

[Translation done.]

* NOTICES *

JPO and NCIPI are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

- 1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
- 2.**** shows the word which can not be translated.
- 3.In the drawings, any words are not translated.

DETAILED DESCRIPTION

[Detailed Description of the Invention]

[0001]

[Industrial Application] This invention relates to the germicide for plantation arts which contains the carboxylic amide derivative which introduced the acyl group, the alkoxyalkyl group, or the carbamoyl group into the nitrogen atom of an amide group, and this derivative as an active principle. [0002]

[Description of the Prior Art] It is widely known from the former that extremely various carboxylic amide shows activity as a herbicide and a germicide, and there are also many drugs marketed as a germicide about a benzoic-acid amide or heterocycle carboxylic amide especially. For example, the - isopropyloxy-2-methyl benzanilide or alpha and alpha, and 3 'alpha-trifluoro -3'-isopropyloxy-2-torr anilide is marketed as a germicide to rice sheath blight disease, the rust of wheat, etc. as a benzoic-acid amide. Moreover, as heterocycle carboxylic amide, 5, the 6-dihydro-2-methyl -1, the 4-OKISA tin-3-carboxy anilide -4, and 4-dioxide are marketed for chrysanthemum white rust, 3, and a 4-dihydro-6-methyl-2H-pyran-5-carboxy anilide as a germicide to the rust of wheat.

[0003] Furthermore, when thiazole carboxylic amide checks work of succinic dehydrogenase, it is indicated by having activity to a Rhizoctonia bacillus, Aust.J.Chem., and 36,135-147 (1983) Pestic.Sci., and 38, 1-7 (1993) that pyrazole carboxylic amide has activity to a Rhizoctonia bacillus similarly. [0004] On the other hand, it is indicated by JP,5-221,994,A and JP,6-199,803,A that the various aromatic-carboxylic-acid anilides which an alkyl group, an alkoxy group, an alkenyl radical, an alkenyloxy radical, the alkynyl group, the alkynyloxy radical, the cyclo alkenyloxy radical, or the phenyl group permuted at least by o- of the amino group have effectiveness in a gray mold (Botorytis bacillus). However, although each compound indicated there examined the sterilization activity over a gray mold about the compound which has a hydrogen atom on the nitrogen atom of an amide, and was indicated concretely there, its prevention effectiveness was low and was not practical. [0005]

[Problem(s) to be Solved by the Invention] therefore -- while the technical problem of this invention shows the outstanding disease control effectiveness -- crops -- also receiving -- safe -- in addition -- and it is in offering the germicide for plantation arts which has new structure.

[0006]

[The means and operation] for solving invention this invention person etc. completed a header and this invention for N and N-JI permutation aniline derivative showing the powerful prevention effectiveness to a gray mold, as a result of inquiring wholeheartedly, in order to solve said technical problem.

[0007] That is, this invention is a general formula (1) (** 5).

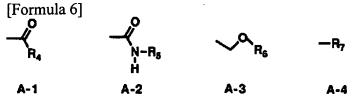
[0008]

[Formula 5]

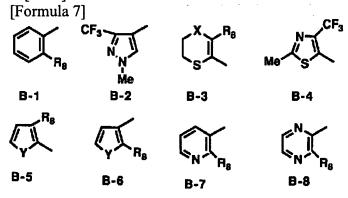
 R_1-N R_2 O R_3

(1)

The inside of [type and R1 mean the radical of either A-1 expressed with the following chemical formulas (** 6) thru/or A-4, and are [0009].



[0010] the inside of a formula, and R4 -- the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the halo alkyl group of 1-8 carbon numbers -- a phenoxymethyl radical -- R5 the alkyl group of 1-8 carbon numbers, or a phenyl group -- expressing -- R6 the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the alkoxyalkyl group of 1-8 carbon numbers -- expressing -- R7 The alkyl group of 1-8 carbon numbers is expressed. R2 The radical of either B-1 expressed with the following chemical formulas (** 7) thru/or B-8 is meant, and it is [0011].



[0012] (Among a formula, in R8, X expresses a methylene group or an oxygen atom, and Y expresses an oxygen atom or a sulfur atom for a halogen atom, the alkyl group of 1-8 carbon numbers, or the halo alkyl group of 1-8 carbon numbers) R3 The radical of either C-1 expressed with the following chemical formulas (** 8) thru/or C-9 is meant.

[0013]

[Formula 8]

[0014] (Among a formula, in R9, R10 and R11 express a hydrogen atom or the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and Y expresses an oxygen atom or a sulfur atom for a hydrogen atom, the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the halo alkyl group of 1-8 carbon numbers.) Moreover, n is R9 when n is two or more for the integer of 1 to 3. Even if the same, you may differ. It is the germicide for plantation arts which contains N [which is expressed with]], and N-JI permutation aniline derivative, and this derivative as an active principle.

[0015] The amide derivative expressed with the general formula (1) of this invention is a new compound, and can be manufactured by making the compound expressed with the carboxylic amide and

the general formula (3) which are expressed with a general formula (2), (4), (5), or (6) by the approach expressed with the following reaction formula 1 thru/or 4 (** 9) react to the bottom of base existence. [0016]

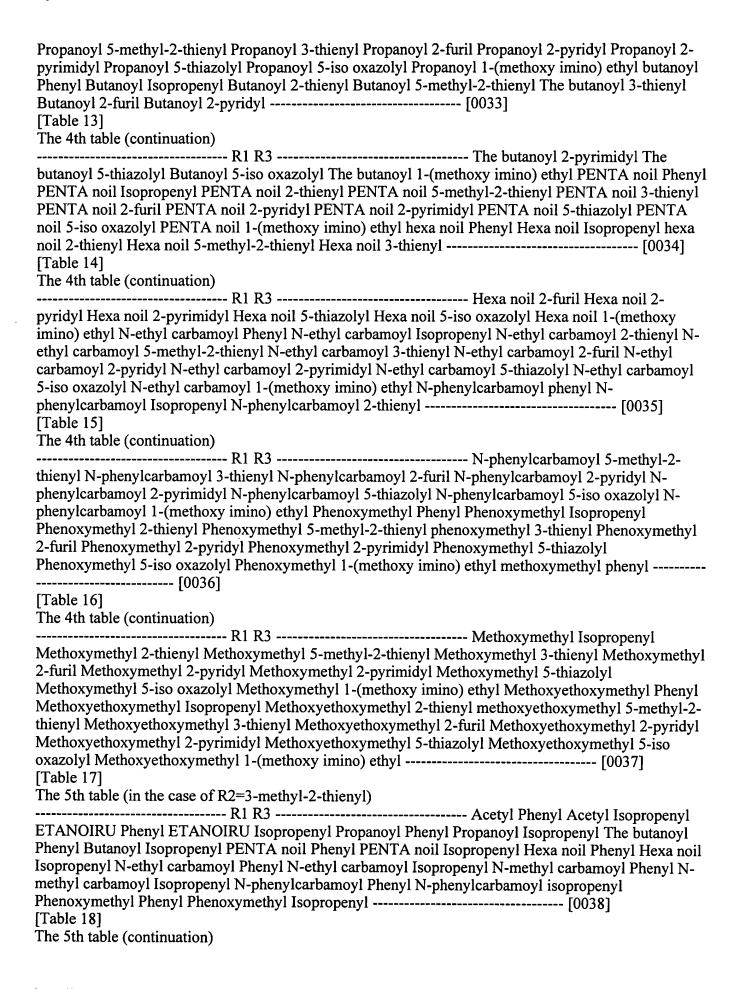
[Formula 9] 反応式 1

[0017] (R1 expresses the aforementioned radical A-2 with a reaction formula 1 for the aforementioned radical A-1 by the reaction formula 2 among a formula, a reaction formula 4 expresses the aforementioned radical A-4 for the aforementioned radical A-3 by the reaction formula 3, R4, R5, R6, and R7 express the same semantics as the above, and Z expresses chlorine or a bromine.)
[0018] As a solvent which can be used for this invention, that what is necessary is just inactive, aromatic hydrocarbon, such as aliphatic hydrocarbon, such as aprotic polar solvents, such as ether, such as the ether and a tetrahydrofuran, dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, and dimethyl imidazolinone, a hexane, and the petroleum ether, benzene, and toluene, is mentioned to a reaction, and these mixed solvents can also be used for it.

[0019] As a base used for this invention reaction, the hydride of alkali metal and alkaline earth metal, For example, the amide of alkali metal, such as sodium hydride and potassium hydride, For example, lithium amide, sodium amide, etc.; The hydroxide of alkali metal and alkaline earth metal, For example, the amide of alkali metal, such as a sodium hydroxide, a potassium hydroxide, and a calcium hydroxide, For example, carbonates of alkali metal and alkaline earth metal, such as lithium amide and sodium amide, For example, a sodium carbonate, potassium carbonate, a calcium carbonate, a magnesium carbonate, etc., The hydrogencarbonate of alkali metal and alkaline earth metal, for example, a sodium hydrogencarbonate, A potassium hydrogencarbonate and alkali-metal alkyl, for example, methyl lithium, Butyl lithium, a phenyl lithium, methyl magnesium chloride, The alkoxide of alkali metal and alkaline earth metal, for example, sodium methoxide, A sodium ethoxide, potassium-t-butoxide, dimethoxy magnesium, etc., Various organic base, for example, triethylamine, pyridine, N, and N-dimethylaniline, N-methyl piperidine, a lutidine, 4-dimethylaminopyridine, etc. are mentioned, and they are sodium hydride and sodium amide especially preferably. Although especially the amount of these

bases used is not restricted, it is used from five-mol % for 20 mol over% to the carboxylic amide preferably expressed with a general formula (2). [0020] The compound preferably used as a germicide for plantation arts with N [of the general formula (1) concerning this invention which can be manufactured by the above manufacture approach], and N-JI permutation aniline derivative The following table [1st] (Tables 1 and 2), It enumerates to the 2nd table (Tables 3-8), the 3rd table (Tables 9 and 10), the 4th table (Tables 11-16), the 5th table (Tables 17 and 18), the 6th table (Tables 19 and 20), the 7th table (Tables 21 and 22), and the 8th table (Tables 23 and 24). [0021] [Table 1] The 1st table (in the case of R2=2-chlorophenyl) ------ R1 R3 ------ Acetyl Phenyl Acetyl Isopropenyl ETANOIRU Phenyl ETANOIRU Isopropenyl Propanoyl Phenyl Propanoyl Isopropenyl The butanoyl Phenyl The butanovl Isopropenyl PENTA noil Phenyl PENTA noil Isopropenyl Hexa noil Phenyl Hexa noil Isopropenyl N-ethyl carbamoyl Phenyl N-ethyl carbamoyl Isopropenyl N-methyl carbamoyl Phenyl Nmethyl carbamoyl Isopropenyl N-phenylcarbamoyl Phenyl N-phenylcarbamoyl isopropenyl phenoxymethyl Phenyl Phenoxymethyl isopropenyl Methoxymethyl Phenyl ------[0022] [Table 2] The 1st table (in the case of R2=2-chlorophenyl) ----- R1 R3 ------ Methoxymethyl Isopropenyl Methoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl ----- [0023] [Table 3] The 2nd table (in the case of R2=3-trifluoromethyl-1-methyl-4-pyrazolyl) ------ Acetyl Phenyl Acetyl Isopropenyl Acetyl 2-thienyl Acetyl 5-methyl-2-thienyl Acetyl 3-thienyl acetyl 2-furil Acetyl 2-pyridyl Acetyl 2pyrimidyl Acetyl 5-thiazolyl Acetyl 5-iso oxazolyl Acetyl 1-(methoxy imino) ethyl ETANOIRU Phenyl ETANOIRU Isopropenyl ETANOIRU 2-thienyl ETANOIRU 5-methyl-2-thienyl ETANOIRU 3-thienyl ETANOIRU 2-furil ETANOIRU 2-pyridyl ETANOIRU 2-pilus midge RUETA noil 5-thiazolyl ----------- [0024] [Table 4] The 2nd table (continuation) ------ R1 R3 ------ ETANOIRU 5-iso oxazolyl ETANOIRU 1-(methoxy imino) ethyl Propanoyl Phenyl Propanoyl Isopropenyl Propanoyl 2-thienyl Propanoyl 5-methyl-2-thienyl Propanoyl 3-thienyl Propanoyl 2-furil Propanoyl 2-pyridyl Propanoyl 2pyrimidyl Propanoyl 5-thiazolyl Propanoyl 5-iso oxazolyl Propanoyl 1-(methoxy imino) ethyl Butanoyl Phenyl Butanoyl Isopropenyl The butanoyl 2-thienyl Butanoyl 5-methyl-2-thienyl The butanoyl 3thienyl Butanoyl 2-furil Butanoyl 2-pyridyl Butanoyl 2-pyrimidyl ------[0025] [Table 5] The 2nd table (continuation) ------ The butanoyl 5-thiazolyl The butanoyl 5-iso oxazolyl The butanoyl 1-(methoxy imino) ethyl PENTA noil Phenyl PENTA noil Isopropenyl PENTA noil 2-thienyl PENTA noil 5-methyl-2-thienyl PENTA noil 3-thienyl PENTA noil 2-furil PENTA noil 2-pyridyl PENTA noil 2-pyrimidyl PENTA noil 5-thiazolyl PENTA noil 5-iso oxazolył PENTA noil 1-(methoxy imino) ethyl Hexa noil Phenyl Hexa noil Isopropenyl Hexa noil 2thienyl Hexa noil 5-methyl-2-thienyl Hexa noil 3-thienyl Hexa noil 2-furil ------[0026] [Table 6] The 2nd table (continuation) pyrimidyl Hexa noil 5-thiazolyl Hexa noil 5-iso oxazolyl Hexa noil 1-(methoxy imino) ethyl N-ethyl

carbamoyl phenyl N-ethyl carbamoyl Isopropenyl N-ethyl carbamoyl 2-thienyl N-ethyl carbamoyl 5methyl-2-thienyl N-ethyl carbamoyl 3-thienyl N-ethyl carbamoyl 2-furil N-ethyl carbamoyl 2-pyridyl Nethyl carbamoyl 2-pyrimidyl N-ethyl carbamoyl 5-thiazolyl N-ethyl carbamoyl 5-iso oxazolyl N-ethyl carbamoyl 1-(methoxy imino) ethyl N-phenylcarbamoyl Phenyl N-phenylcarbamoyl Isopropenyl Nphenylcarbamoyl 2-thienyl N-phenylcarbamoyl 5-methyl-2-thienyl -----[0027] [Table 7] The 2nd table (continuation) ------ N-phenylcarbamovl 3-thienyl Nphenylcarbamoyl 2-furil N-phenylcarbamoyl 2-pyridyl N-phenylcarbamoyl 2-pyrimidyl Nphenylcarbamoyl 5-thiazolyl N-phenylcarbamoyl 5-iso oxazolyl N-phenylcarbamoyl 1-(methoxy imino) ethyl Phenoxy methylphenyl Phenoxymethyl isopropenyl Phenoxymethyl 2-thienyl Phenoxymethyl 5methyl-2-thienyl phenoxymethyl 3-thienyl phenoxymethyl 2-furil Phenoxymethyl 2-pyridyl Phenoxymethyl 2-pyrimidyl Phenoxymethyl 5-thiazolyl Phenoxymethyl 5-iso oxazolyl Phenoxymethyl 1-(methoxy imino) ethyl methoxymethyl Phenyl methoxymethyl Isopropenyl ---------- [0028] [Table 8] The 2nd table (continuation) ------ R1 R3 ------ Methoxymethyl 2-thienyl Methoxymethyl 5-methyl-2-thienyl Methoxymethyl 3-thienyl Methoxymethyl 2-furil Methoxymethyl 2pyridyl Methoxymethyl 2-pyrimidyl Methoxymethyl 5-thiazolyl Methoxymethyl 5-iso oxazolyl Methoxymethyl 1-(methoxy imino) ethyl Methoxyethoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl Methoxyethoxymethyl 2-thienyl methoxyethoxymethyl 5-methyl-2-thienyl Methoxyethoxymethyl 3-thienyl Methoxyethoxymethyl 2-furil Methoxyethoxymethyl 2-pyridyl Methoxyethoxymethyl 2-pyrimidyl Methoxyethoxymethyl 5-thiazolyl methoxyethoxymethyl 5-iso oxazolyl Methoxyethoxymethyl 1-(methoxy imino) ethyl ----- [0029] [Table 9] The 3rd table (in the case of R2=3-methyl OKISA tin-2-IRU) ------ Acetyl Phenyl Acetyl Isopropenyl ETANOIRU Phenyl ETANOIRU Isopropenyl Propanoyl Phenyl Propanoyl Isopropenyl The butanovl Phenyl Butanoyl Isopropenyl PENTA noil Phenyl PENTA noil Isopropenyl Hexa noil Phenyl hexa noil Isopropenyl N-ethyl carbamoyl Phenyl N-ethyl carbamoyl Isopropenyl N-methyl carbamoyl Phenyl Nmethyl carbamoyl Isopropenyl N-phenylcarbamoyl Phenyl N-phenylcarbamoyl isopropenyl Phenoxymethyl Phenyl phenoxymethyl Isopropenyl ----- [0030] [Table 10] The 3rd table (continuation) ----- Methoxymethyl Phenyl Methoxymethyl Isopropenyl Methoxyethoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl ----------- [0031] [Table 11] The 4th table (in the case of R2=4-trifluoromethyl-2-methyl-5-thiazolyl) ------ R1 R3 ------ Acetyl Phenyl Acetyl Isopropenyl Acetyl 2-thienyl Acetyl 5-methyl-2-thienyl Acetyl 3-thienyl Acetyl 2-furil Acetyl 2-pyridyl Acetyl 2pyrimidyl Acetyl 5-thiazolyl Acetyl 5-iso oxazolyl Acetyl 1-(methoxy imino) ethyl ETANOIRU Phenyl ETANOIRU Isopropenyl ETANOIRU 2-thienyl ETANOIRU 5-methyl-2-thienyl ETANOIRU 3-thienyl ETANOIRU 2-furil ETANOIRU 2-pyridyl ETANOIRU 2-pilus midge RUETA noil 5-thiazolyl ----------- [0032] [Table 12] The 4th table (continuation) ------ R1 R3 ------ ETANOIRU 5-iso oxazolyl ETANOIRU 1-(methoxy imino) ethyl Propanoyl Phenyl Propanoyl Isopropenyl Propanoyl 2-thienyl



Methoxymethyl Isopropenyl Methoxyethoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl	
[0039]	
[Table 19] The 6th table (in the case of an R2=2-methyl-3-furil)	
Then y Dutanoy i isoproperly i	_

Since it became timeout time, translation result display processing is stopped.